

⑨ 日本国特許庁 (JP)  
 ⑩ 公開特許公報 (A)

⑪ 特許出願公開  
 昭55-124763

⑫ Int. Cl.<sup>3</sup>  
 C 07 D 213/64  
 213/70

識別記号  
 庁内整理番号  
 7138-4C  
 7138-4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日  
 発明の数 1  
 審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑭ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体  
 ⑮ 特願 昭54-32068  
 ⑯ 出願 昭54(1979)3月19日  
 ⑰ 発明者 西山隆三  
 高槻市真上町5丁目41番22号  
 ⑱ 発明者 藤川致一  
 守山市浮気町321番地の31  
 ⑲ 発明者 横道歎  
 草津市野村町221番地

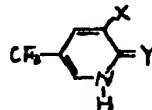
⑳ 発明者 芳賀隆弘  
 草津市野村町221番地  
 ㉑ 発明者 長谷邦昭  
 守山市浮気町321番地の31  
 ㉒ 発明者 林弘仁  
 守山市浮気町321番地の31  
 ㉓ 出願人 石原産業株式会社  
 大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

明細書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

一般式

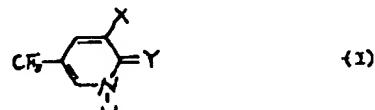


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

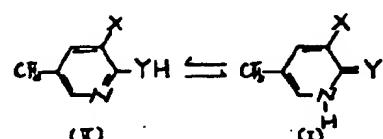
3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中间原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

詳しくは本発明は一般式

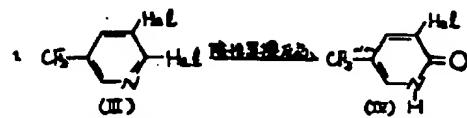


(式中X及びYは前述の通りである)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。

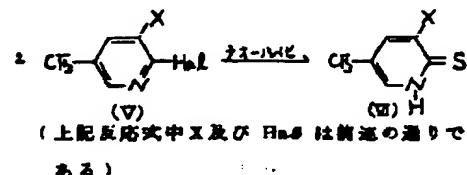


(式中X及びYは前述の通りである)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体としては、Xがハロゲン原子としてハロゲン、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。

本発明 5-トリフルオロメチル-2-ヒリドン誘導体は通常、例えば下記方法によって製造される。

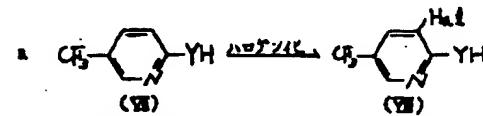


一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶媒中、本陰化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ水溶液を用いて 50 ~ 150°C, 0.1 ~ 10 時間で行なわれる。



一般に上記反応はメタノール、エタノールなどのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

特開昭55-124763(2)  
媒などの溶媒中、テオ尿素、硫酸ソーダ、テオ硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジテオカルバミン酸ソーダなどのオール化剤を用いて 50 ~ 150°C, 0.5 ~ 10 時間で行なわれる。



一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒などの溶媒中、塩素ガス、臭素、テオニルクロライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン化剤を用いて 0 ~ 100°C, 0.5 ~ 10 時間で行なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベンゼン類と結合させて 4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)ニトロベンゼン類を生成させ、これを還元して得られる 4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシアネート

- 3 -

- 4 -

-ト類とを反応させることにより N-ベンゾイル-N'-(4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)ウレア系化合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ヒリドンと 3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを結合、還元して 3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと 2,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-N'-(3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)ウレアを得ることができる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆蟲の防除に有効であって、例えばこの化合物 100 ppm 水分散液にキャベツの葉片を浸漬し、それを風乾してそこへ 2~3 倍のコナガの幼虫を放ち、8 日目に生死を判定した結果、100% の

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例 1 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ヒリドン

〔A〕

5-トリフルオロメチル-2-ヒリドン 2 g をクロロホルム 20 mL に溶解させ、50°C に加温して塩素ガスを 1 時間搅拌下に通じた。反応終了後、クロロホルムを除去し、トルエン-エーテル-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点 144 ~ 147°C の目的物 0.35 g を得た。

〔B〕

水酸化ナトリウム 2.4 g を水 12.5 mL に溶解させた水溶液に 2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルピリジン 4 g を加え、更にジメチルスルホキシド 1.25 mL を加えて加熱し、110°C で 1 時間搅拌下に反応させた。反応終了後生成物を放冷し、無極性で酸性にして沈殿物を得、このものを濾過して目的 2.6

- 5 -

- 6 -

を得た。

合成例 2 5-トリフォルオロメチル-2-チオ  
ビリドン

2-クロロ-5-トリフォルオロメチルビリジン 4 g とチオ尿素 1.67 g をエタノール 30 ml に溶解させ、加熱して還流状態で 3 時間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリウム水溶液 1.23 g を徐々に加えて還流状態で 1 時間反応させた。反応終了後、生成物を放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化メチレンで洗浄し、硫酸で酸性にした。次いで、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレンを留去して融点 147~150°C の目的物 2.1 g を得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフォルオロメチル-2-ビリドン

5-トリフォルオロメチル-2-ビリドン 0.4 g を酢酸 10 ml に溶解させ、そこへ臭素 0.4 g を加えて攪拌下で 4 時間反応させた。反

特許昭55-124763(3)  
反応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-8  
-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点 162  
~165°C の目的物 0.45 g を得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフォルオロメチル-2-チオビリドン

2-クロロ-5-トリフォルオロメチルビリジン 4 g に代えて 2,3-ジクロロ-5-トリフォルオロメチルビリジン 4.75 g を用いる以外は前記合成例 2 と同様にして反応を行ない、後処理を行なって融点 126~128°C の目的物 1.9 g を得た。

特許出願人 石原産業株式会社